

**PATENT ABSTRACTS OF JAPAN**

(11)Publication number : 2003-012511

(43)Date of publication of application : 15.01.2003

(51)Int.Cl.

A61K 31/17  
A61K 7/00  
A61K 9/12  
A61K 45/00  
A61K 47/06  
A61K 47/10  
A61P 17/00  
A61P 17/04  
A61P 17/16

(21)Application number : 2001-195228

(71)Applicant : ROHTO PHARMACEUT CO LTD

(22)Date of filing : 27.06.2001

(72)Inventor : NIWA TAKASHI  
YASUNO RIKAKO**(54) AEROSOL COMPOSITION****(57)Abstract:**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To provide an aerosol composition capable of stably keeping urea in such an amount that the urea exhibits a desirable effect.

**SOLUTION:** This aerosol composition comprises a propellant and a stock solution which contains 2-35 wt.% of the urea and 30-90 wt.% of water, wherein the propellant and the stock solution are together mixed so as to have a mixed volume ratio of the propellant to the stock solution of 10:90 to 75:25 in a liquid state.

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2003-12511

(P2003-12511A)

(43) 公開日 平成15年1月15日 (2003.1.15)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/17 7/00		A 6 1 K 31/17 7/00	4 C 0 7 6 C 4 C 0 8 3 G 4 C 0 8 4 H 4 C 2 0 6 K
審査請求 未請求 請求項の数 7 O L (全 9 頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号	特願2001-195228(P2001-195228)	(71) 出願人	000115991 ロート製薬株式会社 大阪府大阪市生野区巽西1丁目8番1号
(22) 出願日	平成13年6月27日 (2001.6.27)	(72) 発明者	丹羽 岳志 大阪府大阪市生野区巽西1丁目8番1号 ロート製薬株式会社内
		(72) 発明者	安野 利佳子 大阪府大阪市生野区巽西1丁目8番1号 ロート製薬株式会社内
		(74) 代理人	100065215 弁理士 三枝 英二 (外 8 名)
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 エアゾール組成物

(57) 【要約】

【課題】 所望の効果を発揮する量の尿素を安定して保有するエアゾール組成物を提供する。

【解決手段】 噴射剤と、尿素を2〜35重量%及び水を30〜90重量%の割合で含有する原液とからなるエアゾール組成物であって、噴射剤と原液との混合容積比が液体状態で10:90〜75:25であることを特徴とするエアゾール組成物。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 噴射剤と、尿素を2〜35重量%及び水を30〜90重量%の割合で含有する原液とからなるエアゾール組成物であって、噴射剤と原液との混合容積比が液体状態で10:90〜75:25であることを特徴とするエアゾール組成物。

【請求項2】 噴射剤と原液との混合容積比が液体状態で10:90〜50:50であることを特徴とする請求項1に記載のエアゾール組成物。

【請求項3】 原液100重量%中に含まれる尿素の割合が5〜30重量%である請求項1または2に記載のエアゾール組成物。

【請求項4】 噴射剤が、ジメチルエーテル及び液化石油ガスの中から選択される少なくとも1種である請求項1乃至3のいずれかに記載のエアゾール組成物。

【請求項5】 原液中にさらに低級アルコールを0.1〜50重量%の割合で含有する請求項1乃至4のいずれかに記載のエアゾール組成物。

【請求項6】 原液中にさらに多価アルコールを0.1〜30重量%の割合で含有する請求項5に記載のエアゾール組成物。

【請求項7】 原液中にさらに鎮痛成分、消炎鎮痛成分、抗炎症成分、局所麻酔成分、抗ヒスタミン成分、ステロイド成分、抗菌成分、保湿成分、ビタミン成分及び動植物エキスを含有する群から選択される少なくとも1種である請求項1乃至6のいずれかに記載のエアゾール組成物。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、尿素を必須成分とする原液と噴射剤とを含有するエアゾール組成物に関する。より詳細には、本発明は尿素を安定な状態で保持することにより、尿素が有する保湿効果、角質軟化効果または鎮痛効果などといった所望の効果を有効に発揮し、しかも尿素の分解によって生じる悪臭の発生が有意に抑制されているエアゾール組成物に関する。

## 【0002】

【従来の技術】 エアゾール組成物は、主として水性の原液と噴射剤とから構成され、噴射剤としては、通常、液化ガスまたは圧縮ガスが用いられている。かかる噴射剤は、皮膚に塗布した際に皮膚表面から気化熱を奪うことによって使用者に冷却感をもたらす効果を発揮する成分であるため、冷却効果を特徴とするエアゾール組成物には必要不可欠な成分である。

【0003】 ところで、従来より保湿作用、角質軟化作用または鎮痛作用を有する外用剤として尿素を配合した外用剤が知られている。

【0004】 尿素は、角質の水分保持力を増加させて乾燥性角化症における角質層の水分保持力の低下を改善させたり、角質を溶解剝離させる作用を有する他、皮膚浸

透性亢進作用、殺菌作用、創傷治癒作用、細胞賦活作用、さらには、乾燥による掻痒の止痒作用といった各種の作用を有することが知られている。かかる所望の効果をj得るためには製剤中に尿素をある一定濃度以上配合する必要があるが、その水溶性から水を担体として製剤中に尿素を溶解保持させているのが一般的である。

【0005】 しかしながら、反面、尿素は水溶液中で不安定であり、加水分解によってアンモニアと二酸化炭素に分解することが知られている。そして、この分解は熱によって促進される。かかる分解は、尿素に起因する薬効の低下のみならず、pH変動に伴う製剤の劣化や着色またはアンモニア臭の発生による商品価値の低下を招くため、尿素含有製剤の開発において解決しなくてはならない重要な問題である。特に、エアゾール剤の場合は、噴霧というその使用形態から、尿素の分解によって生じる僅かなアンモニアが悪臭の原因となって商品価値を著しく低下させるため、上記問題を解決する意義は大きい。

## 【0006】

【発明が解決しようとする課題】 本発明は、水存在下における尿素の不安定性に伴う尿素含有外用剤の上記問題、特にエアゾール組成物の問題を解決することを目的とするものである。詳細には、本発明は、所望の効果を発揮する量の尿素を安定して保有するエアゾール組成物を提供することを目的とする。より詳細には、本発明は、水の存在下において尿素を安定して保有することによって、尿素の分解に伴う悪臭の発生が有意に抑制されるエアゾール組成物を提供することを目的とする。

【0007】 さらに本発明は、水とともに尿素を必須成分として含有するエアゾール組成物において尿素を安定に保持する方法、並びに尿素の分解に起因する悪臭の発生を防止する方法を提供することを目的とするものである。

## 【0008】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意研究を行なった結果、水及び尿素を必須成分として含有する原液と噴射剤とからなるエアゾール組成物において、原液100重量%中に尿素が2〜30重量%、水が30〜90重量%含まれるように原液を調整し、該原液を噴射剤に対して、原液：噴射剤=25:75〜90:10(液体状態、容積比)の割合となるように配合することによって、(i)水存在中で尿素を安定して保有することができること、(ii)尿素の分解による悪臭の問題が生じないこと、(iii)尿素を有効量安定して含有すること期待する尿素の有効な効果を十分に発揮することができること、などを見出した。そして、かかるエアゾール組成物が、保湿作用、角質軟化作用または鎮痛作用を有するエアゾール剤の成分成分として有用であることを確認した。本発明はかかる知見に基づいて開発されたものである。

【0009】すなわち、本発明は下記に掲げるエアゾール組成物である：

(1) 噴射剤と、尿素を2〜35重量％及び水を30〜90重量％の割合で含有する原液とからなるエアゾール組成物であって、噴射剤と原液との混合容積比が液体状態で10：90〜75：25であることを特徴とするエアゾール組成物。

(2) 噴射剤と原液との混合容積比が液体状態で10：90〜50：50であることを特徴とする(1)に記載のエアゾール組成物。

(3) 原液100重量％中に含まれる尿素の割合が5〜30重量％である(1)または(2)に記載のエアゾール組成物。

(4) 噴射剤が、ジメチルエーテル及び液化石油ガスの中から選択される少なくとも1種である(1)乃至(3)のいずれかに記載のエアゾール組成物。

(5) 原液中にさらに低級アルコールを0.1〜50重量％の割合で含有する(1)乃至(4)のいずれかに記載のエアゾール組成物。

(6) 原液中にさらに多価アルコールを0.1〜30重量％の割合で含有する(5)に記載のエアゾール組成物。

(7) 原液中にさらに鎮痒成分、消炎鎮痛成分、抗炎症成分、局所麻酔成分、抗ヒスタミン成分、ステロイド成分、抗菌成分、保湿成分、ビタミン成分及び動植物エキスを少なくとも選択される少なくとも1種である(1)乃至(6)のいずれかに記載のエアゾール組成物。

(1)乃至(6)のいずれかに記載のエアゾール組成物。

【0010】さらに本発明は上記のエアゾール組成物を内容成分として有するエアゾール剤である。当該エアゾール剤は、特に保湿効果、角質軟化効果または鎮痒効果を有する外用剤(化粧品、医薬品、医薬部外品)として有用である。よって、本発明は、エアゾール剤の形態を有する保湿製剤、エアゾール剤の形態を有する角質軟化製剤、エアゾール剤の形態を有する鎮痒製剤と言い換えることもできる。

【0011】また本発明は、水とともに尿素を必須成分として含有するエアゾール組成物において尿素を安定に保持する方法に関する。当該方法は、噴射剤と、尿素を2〜35重量％及び水を30〜90重量％の割合で含有する原液とを、液体状態で10：90〜75：25(容積比)の割合で混合してなるエアゾール組成物を調製することによって実現することができる。

【0012】さらに本発明は、水とともに尿素を必須成分として含有するエアゾール組成物において尿素の分解に起因する悪臭の発生を防止する方法に関する。当該方法は、噴射剤と、尿素を2〜35重量％及び水を30〜90重量％の割合で含有する原液とを、液体状態で10：90〜75：25(容積比)の割合で混合してなるエアゾール組成物を調製することによって実現する、と

ができる。

【0013】

【発明の実施の形態】本発明のエアゾール組成物は、尿素と水を必須成分として含有する原液、及び噴射剤とからなるものである。

【0014】ここで尿素は、前述するように、製剤中に一定濃度以上の割合で配合することによって角質の水分保持量を増加させて乾燥性角化症における角質層の水分保持量の低下を改善させたり、角質を溶解剥離させる作用を有する他、皮膚透過性亢進作用、殺菌作用、創傷治癒作用、細胞賦活作用、さらには、乾燥による掻痒の止痒作用といった各種の作用を有することが知られている。従って、本発明においてはこれらの尿素の効果を有効に発揮させるために、エアゾール組成物に配合する原液(薬液)100重量％中に尿素を2重量％以上の割合で配合することが好ましい。本発明において、原液中に2重量％以上の尿素を配合することによって、保湿効果、鎮痒効果および角質軟化効果を有するエアゾール組成物、中でも特に保湿効果に優れたエアゾール組成物を調製することができる。また5重量％以上の尿素を配合することによって、特に鎮痒効果に優れたエアゾール組成物を調製することができる。さらに10重量％以上の尿素を配合することによって、特に角質軟化効果に優れたエアゾール組成物を調製することができる。

【0015】原液に配合する尿素の上限は、エアゾール組成物中の尿素の安定性、なかでも特に尿素の分解による悪臭発生防止を考慮して、原液に配合する水の配合割合、並びに原液と組み合わせる噴射剤の配合割合との関係から規定することができる。本発明においては原液(薬液)100重量％に配合する尿素の上限として35重量％、好ましくは30重量％を挙げることができる。すなわち、本発明において、尿素を原液100重量％中に2〜35重量％、好ましくは5〜30重量％の範囲で配合することによって、尿素が本来有する所望の効果を発揮することができ、しかもその安定性に優れたエアゾール組成物を調製することができる。

【0016】原液中に配合する水の配合割合は、尿素の溶解性、及び安定性、なかでも特に尿素の分解による悪臭発生防止を考慮して、上記する原液中の尿素の配合割合、並びに原液と組み合わせる噴射剤の配合割合との関係から規定することができる。原液100重量％中の水の配合割合として通常30〜90重量％、好ましくは30〜75重量％、より好ましくは30〜60重量％の範囲を挙げることができる。

【0017】本発明のエアゾール組成物に用いられる原液は、少なくとも上記の尿素及び水を必須成分とするものであればよく、本発明の効果を妨げないことを限度として他の成分を配合することはいかなる制限もない。

【0018】かかる他成分として、例えば低級アルコールを挙げることができる。ここで低級アルコールとは

は、例えば、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノールなどの炭素数1～6の直鎖状若しくは分岐状のアルコールを挙げることができる。中でも成分の製剤安定性の面からエタノール、またはイソプロパノールが好ましい。なお、これらの低級アルコールは1種単独で使用しても、2種以上を任意に組み合わせ使用することもできる。

【0019】低級アルコールは、原液またはエアゾール組成物に対する尿素または他の成分の安定性を高めるのに有用である。例えば、他成分としてクロタミンを配合する場合には、低級アルコールによって溶解性を高め、安定な製剤とすることができる。また、低級アルコールの配合によってエアゾール組成物を皮膚に塗布した際、気化熱によって皮膚に冷却感を与え、爽快感を与えることができる。さらに低級アルコールは、原液中の水と噴射剤との相溶性を高め、エアゾール組成物を均質化するのに有効である。

【0020】かかる効果を得る目的から、低級アルコールを配合する場合は、原液100重量%中に0.1重量%以上、好ましくは5重量%以上、より好ましくは10重量%以上の割合で用いることが好ましい。なお、低級アルコールの配合は、気化熱の放散によって冷却効果が得られる反面、同時に皮膚を奪って皮膚の乾燥を招く傾向があるため、かかる乾燥による悪影響を防止するためには、原液に対して50重量%、好ましくは40重量%以上と配合することが好ましい。

【0021】また他の成分として、多価アルコールを挙げることができる。ここで多価アルコールとしては、具体的にはプロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、グリセリン、ジエチレングリコール、トリエチレングリコール、ジプロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、エトキシジグリコールなどが例示される。なお、これらの多価アルコールは1種単独で使用しても、2種以上を任意に組み合わせ使用することもできる。好ましくは、安全性と保湿効果の点から、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、エトキシジグリコールまたはグリセリンである。

【0022】多価アルコールの配合は、気化熱の放散によって生じる冷却感を緩和したり、脱脂による乾燥から皮膚を保護するのに有効であることから、上記する低級アルコールと併用して用いられることが好ましい。

【0023】多価アルコールを配合する場合は、原液100重量%中に0.1～30重量%、好ましくは0.1～20重量%、より好ましくは3～10重量%の割合で用いることができる。

【0024】また本発明に用いる原液には、尿素以外の有効成分を配合することもできる。

【0025】このような有効成分としては、外用剤に適配する、とのできる各種の有効成分を用いる、とが

できる。好ましくは保湿効果、鎮痛効果、角質軟化効果を有するか、またこれらの効果を増強する効果を有する成分が望ましい。具体的には、鎮痛成分、消炎鎮痛成分、抗炎症成分、局所麻酔成分、抗ヒスタミン成分、ステロイド成分、抗菌成分、保湿成分、ビタミン成分、局所麻痺成分、及び動植物エキスをなどを例示することができる。なお、これらの1種もしくは2種以上を組み合わせ使用することができる。

【0026】ここで鎮痛成分としては、クロタミジン、イクタモール、モクタモールまたはチモール酸などが例示される。好ましくはクロタミジンである。また、消炎鎮痛成分としては、インドメタシン、サリチル酸及びこれらの誘導体（サリチル酸メチル、サリチル酸モノグリコールエステルなど）、ケトプロフェン、フルビプロフェン、ピロキシカム、ジクロフェナック、イブプロフェン、またはメフェナム酸などが例示される。好ましくはサリチル酸またはその誘導体である。抗炎症成分としては、グアイアズレンまたはその塩、アラントイン、グリチルレチン酸またはその誘導体（グリチルレチン酸の硝酸エステル若しくは酢酸エステルなど）、グリチルリチン酸またはその誘導体（グリチルリチン酸の酢酸エステル若しくは酢酸エステル、グリチルリチン酸ステアリン酸）が例示される。好ましくは、アラントイン、グリチルレチン酸またはその誘導体、グリチルリチン酸またはその誘導体である。局所麻酔成分としては、リドカイン、ジブカイン、アミノ酸安息香酸エチル等が例示できる。好ましくはリドカインまたはジブカインである。抗ヒスタミン成分としてはクロルフェニラミン、ジフェンヒドラミン、イソチンベンジル及びこれらの誘導体等が例示できる。ステロイド成分としては、ヒドロコルチゾン、デキサメタゾン、プレドニゾンまたはこれらの誘導体等が例示できる。抗菌成分としては、ウンデシレン酸、ペンタクロールフェノール、クロトリマゾール、トルナフテート、トリコマイシン、ミコナゾール、ヨウ化カリウム、クロルヘキシジン、アクリノール、ベンザルコニウム、ペニシリン、テトラサイクリン、フラジオマイシン、カナマイシンまたはこれらの誘導体等が例示できる。

【0027】また、保湿成分としては、グリセリン、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ジプロピレングリコール等の多価アルコール；スクワラン、流動パラフィン、アボガド油、大豆油、ヒマシ油、コメ胚芽油等の液状油；グリシン、アラニン、アスパラギン酸等のアミノ酸；ソルビトール、マルチトール、トハロース、グルコースなどの糖類；乳酸またはピロリドンカルボン酸の有機酸を例示することができる。ビタミン成分としては、NMF成分や肌の損傷を回復したり、炎症を抑える効果を有するものが好ましく、トコフェロールなどのビタミンE及びその誘導体、ビロキシジンなどのビタミンB6及びその誘導体、レチノールなどのビタミン

ンA及びその誘導体、バントテン酸及びその誘導体、アスコルビン酸等のビタミンC及びその誘導体、ヒオチンなどを例示することができる。局所麻痺成分としては、トウガラシ、カラシ、カンタリス、カンタリジン、カプサイシンなどが例示される。また、動植物エキスとしては、保湿効果、抗炎症効果、または肌荒れに対して改善効果のあると言われているものが好ましく、具体的には、セラチン類、コラーゲン類、ヒアルロン酸、コンドロイチン硫酸、アロエ抽出物、ハマリス抽出物、ローズマリー抽出物、マロニエ抽出物、きゅうり抽出物、トウキンセンカ抽出物、ローヤルゼリー抽出物、海藻抽出物、茶抽出物、ニンジン抽出物、桃抽出物、桃の葉抽出物、カンゾウ抽出物、オウゴン抽出物、ユーカリ抽出物、ハッカ抽出物、ラベンダー抽出物、月見草抽出物、カミツレ抽出物、トウキ抽出物、コメ発酵エキスなどが挙げられる。

【0028】なお、前述する各具体的な成分には、その薬学上許容される塩、特に外用を目的に当業界で通常使用される薬学上許容される塩も包含される。

【0029】本発明で用いる原液は、通常pH2～10の液性を備えていけばよいが、皮膚に対する低刺激性、及び皮膚使用感のよさという観点から、好ましくはpH3～9、より好ましくはpH5～8の弱酸性～中性であることが望ましい。

【0030】また、原液の粘度が0.5cSt未満であるとエアゾール組成物の皮膚付着性が低下し、また粘度が20cStを超えると皮膚にべたつき感が残る傾向がある。このため、良好な使用感を得るという点からは、原液の粘度を、通常1cSt～20cStの範囲に調整することが望ましい。なお、ここで粘度は、BL粘度計（BLアダプタ使用、回転数30rpm、測定温度29℃、密度測定：ピクノメーター使用）で測定した動粘度を意味する。好ましくは1cSt～10cSt、より好ましくは1cSt～5cStである。

【0031】本発明のエアゾール組成物は、前述する原液に噴射剤を配合して調製することができる。

【0032】本発明で用いられる噴射剤としては、前述する原液に対して相溶性を有するものであればよく、具体的には液化石油ガス（例えばエタン、プロパン、エチレン、イソブタン、ノルマルブタン、プロピレンなどのように容易に液化するガス、これらの混合ガス（例えば、イソブタンとプロパン、プロパンとブタンの混合ガス等））、エーテル系噴射剤（ジメチルエーテル等）、フロカーボン（例えば、フロカーボン、クロロフロロカーボン、ブロモクロロフロロカーボン）、圧縮ガス（二酸化炭素、空気またはこれらの混合ガス名等）、またはフロンガス（モノクロロジフルオロエタン、テトラフルオロエタン等）を例示することができる。なお、これらの噴射剤は1種単独で使用しても2種以上を任意に組み合わせ使用することもできる。好ましくはジメチル

ルエーテル、または液化石油ガスであり、特に好ましくは、冷却感を含めた使用感に優れたジメチルエーテル、またはジメチルエーテルと液化石油ガスとの混合ガスである。

【0033】本発明のエアゾール組成物における原液と噴射剤の混合比は、液体状態における容量基準で原液：噴射剤＝25：75～90：10（容積比）であることが好ましい。より好ましくは原液：噴射剤＝50：50～90：10である。エアゾール組成物中に配合される原液の割合が25容量％未満では、尿素の安定性が十分に保持されない傾向があり、一方、噴射剤の割合が25容量％未満であるとき、エアゾール剤として使用した場合に有効成分を含む原液の全てを最後まで使用することができず、容器中に残液してしまう傾向がある。

【0034】本発明のエアゾール組成物には、必要に応じて、清涼剤、溶解補助剤、界面活性剤、キレート剤、pH調整剤、防腐剤、酸化剤、または香料等が配合されていてもよい。

【0035】なかでも、清涼剤は、冷却感を増加させる効果があり、使用感に優れるのみならず、痒みを即時的に抑制する効果を有するため鎮痒を目的としたエアゾール剤の調製には有用である。清涼剤としては、1-メントールや3-1-メントキシプロパン-1,2-ジオールが好ましい。とくに、1-メントールまたは1-メントールを含有する精油が好ましい。

【0036】また、溶解補助剤としては、アジピン酸ジイソプロピル、ミリスチン酸イソプロピル、1,3-ブチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、グリセリン、乳酸、水酸化ナトリウム等；界面活性剤としては、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンセシルエーテル、モノステアリン酸グリセリル等；キレート剤としてはエデト酸類、ヒドロキシエタンジホスホン酸類、フチン酸等；防腐剤としてはパラベン、安息香酸塩、イソプロピルメチルフェノール等；酸化剤としては酢酸トコフェロール、ジブチルヒドロキソニルエーテル、ブチルヒドロキソニルエーテル等が例示できる。

【0037】本発明のエアゾール組成物は、原液と噴射剤をスチールまたはアルミなどのエアゾール容器に公知の方法により充填してエアゾール形態として使用される。本発明の目的が損なわれない限り、原液の組成のみならず、内容物の噴射量または噴霧・噴射状態は、エアゾール容器内の圧力やエアゾール容器のバルブにおける噴射孔径またはステム通路の径等を適宜設定することによって目的に応じて適宜選択して使用することができる。

【0038】本発明のエアゾール組成物は、例えば、ファンデーション、口紅、及び爪爪料等のメーキャップ化

粧料や基礎化粧料；洗顔料やクレンジング、ボディ洗剤などの洗剤；脱臭防止剤、水虫治療剤、鎮痒剤、創傷治療剤、消炎鎮痛剤、にきび治療剤、殺菌消毒剤、美白剤、紫外線防御剤、保湿剤、角質軟化剤などの、化粧品、外用医薬品または外用医薬部外品の分野に属する各種の外用途にエアゾール剤として使用することができる。本発明は、尿素の効果である保湿効果、角質軟化効果または鎮痒効果を有するエアゾール剤として調製されることが好ましい。具体的には、保湿効果、角質軟化効果または鎮痒効果を有するエアゾール剤形態の化粧料ま

たは洗剤、エアゾール剤の形態を有する鎮痒剤、保湿剤または角質軟化剤を例示することができる。

#### 【0039】

【実施例】以下に本発明を実施例及び試験例に基づいてさらに詳細に説明するが、本発明はこれら実施例等に限定されるものではない。なお、下記の各処方において％とは、特に言及しない限り、重量(W/W)％を意味するものとする。

#### 【0040】

##### 実施例1 保湿製剤

###### <原液>

尿素	10.0 (%)
ビタミンE	5.0
1,3-ブチレングリコール	5.0
エタノール	40.0
精製水	40.0

合計 100.0%

###### <噴射剤>

ジメチルエーテル	100.0%
----------	--------

<原液> : <噴射剤> = 70 : 30 (容積比)

#### 【0041】

##### 実施例2 化粧料

###### <原液>

尿素	5.0 (%)
グリセリン	5.0
乳酸	1.5
エタノール	30.0
香料	0.1
精製水	58.4

合計 100.0%

###### <噴射剤>

液化石油ガス	100.0%
--------	--------

<原液> : <噴射剤> = 60 : 40 (容積比)。

#### 【0042】

##### 実施例3 皮膚保護フォーム

###### <原液>

尿素	7.0 (%)
ヒドロキシエチルセルロース	0.3
キサンタンガム	0.1
プロピレングリコール	5.0
スクワラン	1.0
セタノール	1.0
モノステアリン酸グリセリル	0.2
ポリオキシエチレンセチルエーテル	0.3
KSG16 (信越化学)	0.5
ラウリルメチルタウリンNa	3.0
エタノール	1.0
香料	0.2
精製水	80.4

合 計	100.0%
<噴射剤>	
ジメチルエーテル	50.0
液化石油ガス	50.0
	100.0%

<原液：噴射剤>=55：45（容積比）。

【0043】

**実施例4** シェービングフォーム

<原液>	
尿素	15.0 (%)
ステアリン酸ポリグリセリド	1.0
ジブロピレングリコール	20.0
ステアリン酸	0.5
セタノール	2.0
パラフィン	0.5
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	1.0
シリコーンKF-96A(20cs) (信越化学)	1.0
ヒドロキシエチルセルロース	0.4
水酸化ナトリウム (pH7に調整)	0~0.1
精製水	58.5~58.6
合 計	100.0%

<噴射剤>	
液化石油ガス	100.0%

<原液：噴射剤>=95：5（容積比）。

【0044】

**実施例5** 鎮痛剤

<原液>	
尿素	8.0 (%)
マレイン酸クロロフェニラミン	1.0
クロタミトン	5.0
アレドニゾロン	0.1
アラントイン	0.1
イソプロピルメチルフェノール	0.1
l-メントール	0.2
エタノール	40.0
精製水	45.5
合 計	100.0%

<噴射剤>

液化石油ガス：ジメチルエーテル=50：50

<原液：噴射剤>=80：20（容積比）。

【0045】

**実施例6** 水虫用剤

<原液>	
尿素	5.0 (%)
硝酸スルコナゾール	0.5
塩酸ジブカイン	0.1
エタノール	3.0
精製水	91.4
合 計	100.0%
<噴射剤>	



ジメチルエーテル：液化石油ガス＝90：10  
 <原液：噴射剤>＝50：50（容積比）。

【0046】

**実施例7 角質軟化剤**

&lt;原液&gt;

尿素	25.0 (%)
ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル	1.0
グリセリン	3.0
ホホバ油	5.0
精製水	66.0
合 計	100.0 %.

&lt;噴射剤&gt;

ジメチルエーテル：液化石油ガス＝40：60

&lt;原液：噴射剤&gt;＝80：15（容積比）。

【0047】**試験例1** エアゾール組成物における尿素的安定性

表1に記載する処方に従って、尿素と水を所定量の割合で含有する原液を調製し、次いでこの原液と噴射剤を所定の割合で混合し、エアゾール缶に充填し、40℃の恒温槽に1ヶ月間保存して、尿素的安定性（耐分解性、溶解安定性）を確認した（実施例8～16、比較例1～4）。

【0048】（1）安定性（耐分解性）  
 エアゾール組成物（実施例8～16、比較例1～4）の安定性（耐分解性）は、尿素は分解するとアンモニアを発生することを利用して、1.5秒間スプレーした際の噴霧物のアンモニア臭の有無から評価した。

【0049】アンモニア臭の強さを下記に示す5段階で評価した。

— アンモニア臭を感じない

微量感じる  
 ++ 有意に感じる  
 +++ かなり感じる  
 ++++ 強く感じる  
 +++++ 不快なほど強く感じる。

【0050】（2）溶解安定性

エアゾール組成物（実施例8～16、比較例1～4）の溶解安定性は、エアゾール缶の内容物（エアゾール組成物）の状態を顕微鏡で観察して沈殿物若しくは結晶析出の有無を調べることによって評価した。さらに、噴霧後、エアゾール缶を室温に1日間放置した後の該缶の噴射口における結晶析出の有無を目視で観察した。結晶析出の有無については有りを+、無しを-で評価した。結果を表1に合わせて示す。

【0051】

【表1】

	比較例				実施例									
	1	2	3	4	8	9	10	11	12	13	14	15	16	
原液の組成														
尿素	10	10	10	40	10	10	10	10	10	10	10	10	10	
アロニゲノール	0	10	10	0	10	0	0	30	0	0	10	0	0	
エタノール	40	50	65	30	50	30	0	30	30	0	50	30	0	
精製水	50	30	15	30	30	60	90	30	60	90	30	60	90	
合計	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
原液：噴射剤の割合														
原液	20	20	50	50	25	25	25	50	50	50	90	90	90	
噴射剤（ジメチルエーテル）	80	80	50	50	75	75	75	50	50	50	10	10	10	
保存安定性 （40℃1ヶ月）	+++	++++	+	+++	—	—	+	—	—	—	—	—	—	
結晶析出の有無 （40℃1ヶ月後）	+	+	+	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	
噴出口の結晶の有無 （40℃1ヶ月後）	+	+	+	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	

【0052】表1の結果からわかるように、本発明の処方からなるエアゾール組成物は、いずれも熱安定性（耐分解性、溶解安定性）に優れており、この結果から長期

保存においても尿素を安定して保有することが示された。

【0053】

【発明の効果】本発明のエアゾール組成物は、尿素と水とを特定の割合で含有する原液を特定の割合で噴射剤と配合して調製されてなることを特徴とするものである。かかる処方によって調製された本発明のエアゾール組成物によれば、水の共存下でも尿素を長期にわたり安定して保有するため、配合した量に応じて尿素の所望の効果（保湿効果、角質軟化硬化、鎮痒効果）を発揮できると

ともに、尿素の分解による悪臭の発生がないため噴霧吐出して使用されるエアゾール剤（噴霧剤）の内容組成物として適している。また本発明のエアゾール組成物は、長期保存によっても尿素が析出したり沈殿することなく安定して保有されるため、エアゾール容器の吐出口に詰まるなどといった不都合も生じず、エアゾール剤（噴霧剤）の内容組成物として有用に使用することができる。

# フロントページの続き

(51)Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テームド (参考)
A 6 1 K	7/00	A 6 1 K	7/00
	9/12		9/12
	45/00		45/00
	47/06		47/06
	47/10		47/10
A 6 1 P	17/00	A 6 1 P	17/00
	17/04		17/04
	17/16		17/16

F ターム (参考) 4C076 AA24 BB31 CC04 CC18 CC20  
DD34 DD37 DD38 DD39 FF57  
FF70  
4C083 AB032 AC011 AC012 AC022  
AC072 AC101 AC102 AC111  
AC122 AC152 AC171 AC172  
AC182 AC242 AC302 AC392  
AC432 AC681 AC682 AC792  
AD042 AD112 AD282 AD352  
AD662 CC21 DD08 EE10  
EE12  
4C084 AA02 AA03 AA16 AA27 CA13  
CA17 CA59 MA02 MA13 MA63  
NA05 ZA082 ZA212 ZA902  
ZA912 ZB112 ZC132  
4C206 AA01 HA27 MA01 MA02 MA05  
MA83 NA05 ZA89 ZA91